

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2017100921, 12.06.2015

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
13.06.2014 US 62/012,042;
13.06.2014 US 62/012,051;
17.11.2014 US 62/080,760;
17.11.2014 US 62/080,779;
02.12.2014 US 62/086,466

(43) Дата публикации заявки: 13.07.2018 Бюл. № 20

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 13.01.2017(86) Заявка РСТ:
IB 2015/054457 (12.06.2015)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2015/189814 (17.12.2015)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры"(71) Заявитель(и):
ОНКОЭТИКС ГМБХ (CH)(72) Автор(ы):
РИВЕЙРО Мария Юджения (FR),
РАЙМОН Эрик (FR),
БЕРТОНИ Франческо (CH)(54) СПОСОБ ЛЕЧЕНИЯ НЕМЕЛКОКЛЕТОЧНОГО РАКА ЛЕГКИХ ИЛИ МЕЛКОКЛЕТОЧНОГО
РАКА ЛЕГКИХ С ПРИМЕНЕНИЕМ СОЕДИНЕНИЙ ТИЕНОТРИАЗОЛОДИАЗЕПИНА

(57) Формула изобретения

1. Способ лечения немелоклеточного рака легких или мелоклеточного рака легких у млекопитающего, включающий стадию введения пациенту фармацевтически приемлемого количества соединения, которым является дигидрат (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-а][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенил)ацетамида, (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-а][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенил)ацетамид или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Способ по п. 1, также включающий введение лекарственного средства, которое является ингибитором m-TOR или ингибитором ALK.

3. Способ по п. 2, где соединение и лекарственное средство вводят одновременно.

4. Способ по п. 2, где соединение и лекарственное средство вводят последовательно.

5. Способ по п. 2, где лекарственным средством является ингибитор m-TOR.

6. Способ по п. 5, где ингибитор mTOR выбирают из группы, включающей рапамицин, темсиролимус, ридафоролимус и эверолимус.

7. Способ по п. 6, где ингибитором mTOR является эверолимус.

R U 2 0 1 7 1 0 0 9 2 1

A
2 0 1 7 1 0 0 9 2 1
R U

8. Способ по п. 2, где лекарственным средством является ингибитор ALK.
9. Способ по п. 8, где ингибитором ALK является кризотиниб.
10. Способ по п. 1, где соединением является дигидрат (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-a][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенила)ацетамида.
11. Способ по п. 10, где дигидрат (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-a][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенила)ацетамида получают в виде твердой дисперсии.
12. Способ по п. 11, где твердая дисперсия содержит аморфный дигидрат (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-a][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенила)ацетамида и фармацевтически приемлемый полимер.
13. Способ по п. 12, где фармацевтически приемлемым полимером является сукцинат ацетата гидроксипропилметилцеллюлозы, и где массовое отношение дигидрата (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-a][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенила)ацетамида к сукцинату ацетата гидроксипропилметилцеллюлозы (САГПМЦ) составляет от 1:3 до 1:1.
14. Способ по п. 12, где твердая дисперсия имеет порошковую рентгеновскую дифрактограмму, практически не содержащую линии дифракции, связанные с кристаллическим дигидратом (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-a][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенила)ацетамида.
15. Способ по п. 12, где твердая дисперсия имеет одну точку перехода температуры стеклования (Tg) от около 130°C до около 140°C.
16. Дигидрат (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-a][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенила)ацетамида для применения для лечения немелкоклеточного рака легких или мелкоклеточного рака легких.
17. Твердая дисперсия дигидрата (S)-2-[4-(4-хлорфенил)-2,3,9-триметил-6Н-тиено[3,2-f][1,2,4]триазоло-[4,3-a][1,4]диазепин-6-ил]-N-(4-гидроксифенила)ацетамида и фармацевтически приемлемого полимера для применения для лечения немелкоклеточного рака легких или мелкоклеточного рака легких.